

## ⑫ 公開特許公報(A)

平4-128275

⑤ Int. Cl.<sup>5</sup>

C 07 D 277/56

A 01 N 43/76

43/78

識別記号

庁内整理番号

9164-4C

8930-4H※

A

⑬ 公開 平成4年(1992)4月28日

審査請求 未請求 請求項の数 2 (全9頁)

⑭ 発明の名称 N-ベンジルアミド類およびこれを有効成分とする殺虫、殺ダニ剤

⑮ 特 願 平2-249254

⑯ 出 願 平2(1990)9月19日

⑰ 発 明 者 細 川 明 美 神奈川県横浜市緑区鴨志田町1000番地 三菱化成株式会社  
総合研究所内⑰ 発 明 者 三 浦 由 美 子 神奈川県横浜市緑区鴨志田町1000番地 三菱化成株式会社  
総合研究所内⑰ 発 明 者 田 中 敏 彦 神奈川県横浜市緑区鴨志田町1000番地 三菱化成株式会社  
総合研究所内⑰ 発 明 者 福 地 俊 樹 神奈川県横浜市緑区鴨志田町1000番地 三菱化成株式会社  
総合研究所内

⑰ 出 願 人 三菱化成株式会社 東京都千代田区丸の内2丁目5番2号

⑰ 代 理 人 弁理士 長谷川 一 外1名

最終頁に続く

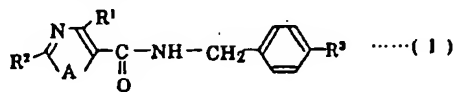
## 明 細 書

## 1. 発明の名称

N-ベンジルアミド類およびこれを有効成分とする  
殺虫、殺ダニ剤

## 2. 特許請求の範囲

(1) 下記一般式(I)



[上記式中、Aはイオウ原子または酸素原子を示す。R<sup>1</sup>は水素原子、メチル基、エチル基またはトリフルオロメチル基を示し、R<sup>2</sup>は水素原子、炭素数1~3のアルキル基、フェニル基、炭素数1~3のアルコキシ基、ハロゲン原子、メルカプト基、炭素数1~3のアルキルチオ基、炭素数2~4のアルコキシカルボニル基、アミノ基、炭素数1~3のアルキルアミノ基、または炭素数1~3のアシルアミノ基を示す。R<sup>3</sup>は炭素数1~5の直鎖もしくは分岐鎖アルキル基、炭素数2~5のアルケニル基、炭素数1~5のアルコキシ基または  $-\text{O}-\text{C}_6\text{H}_4-\text{R}_4$

(式中、R<sup>4</sup>は水素原子、炭素数1~5のアルキル基、炭素数2~5のアルケニル基、炭素数1~5のトリフルオロメチル基、シアノ基、炭素数1~3のアルキルチオ基、炭素数1~3のアルキルスルフィニル基、炭素数1~3のアルキルスルホニル基、ニトロ基、またはハロゲン原子を表わす)を示す]で表わされるN-ベンジルアミド類。

(2) 請求項(1)記載のN-ベンジルアミド類を有効成分とする殺虫、殺ダニ剤。

## 3. 発明の詳細な説明

## [産業上の利用分野]

本発明は、N-ベンジルアミド類およびこれを有効成分とする殺虫、殺ダニ剤に関する。

## [従来技術および発明が解決しようとする課題]

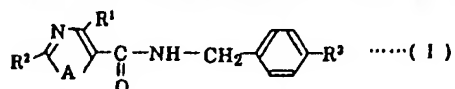
近年、殺虫剤および殺ダニ剤の長年の使用により、害虫に抵抗性が生じ、従来の殺虫剤および殺ダニ剤による防除が困難となっている。例えば、代表的殺虫剤である有機リン剤やカーバメイト剤に対しては、広く抵抗性害虫の発生が問題となっており、また合成ピレスロイド系殺虫剤に対しても、抵抗性の発達が報告されている。

一方、従来より各種のカルボキサミド類が報告され、例えば西独特許2332733号公報には精神治療安定剤としてのチアゾールカルボキサミド類が、欧州特許279239号公報には抗真菌作用、殺虫作用を有するチアゾールカルボキサミド類が、また西独特許2320387号公報には抗動脈硬化剤としてのカルボキサミド類が各々記載されているが、殺虫、殺ダニ活性についての報告は知られていない。このような状況のもと、新規な殺虫、殺ダニ剤の開発が望まれている。

#### [課題を解決するための手段]

本発明者らは、このような状況に対処すべく鋭意研究を行った結果、優れた殺虫、殺ダニ活性を有する新規なN-ベンジルアミド類を見出し、本発明を完成するに至った。

すなわち、本発明の要旨は、下記一般式(I)



[上記式中、Aはイオウ原子または酸素原子を示す。R<sup>1</sup>は水素原子、メチル基、エチル基またはト

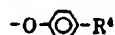
素原子を示す。

R<sup>1</sup>は水素原子、メチル基、エチル基、またはトリフルオロメチル基を示す。

R<sup>2</sup>は水素原子；メチル基、エチル基、n-プロピル、イソプロピル基等の炭素数1~3の直鎖もしくは分岐鎖アルキル基；フェニル基；メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、イソプロポキシ基等の炭素数1~3の直鎖もしくは分岐鎖アルコキシ基；塩素原子、臭素原子のハロゲン原子；メルカプト基；メチルチオ基、エチルチオ基、n-プロピルチオ基、イソプロピルチオ基等の炭素数1~3の直鎖もしくは分岐鎖アルキルチオ基；メトキシカルボニル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボニル基等の炭素数2~4の直鎖もしくは分岐鎖アルコキシカルボニル基；アミノ基；メチルアミノ基、エチルアミノ基、n-プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基等の炭素数1~3の直鎖もしくは分岐鎖アルキルアミノ基；またはホルミルアミノ基、アセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基等の炭素数1~3のアシルアミノ基を示す。

リフルオロメチル基を示し、R<sup>3</sup>は水素原子、炭素数1~3のアルキル基、フェニル基、炭素数1~3のアルコキシ基、ハロゲン原子、メルカプト基、炭素数1~3のアルキルチオ基、炭素数2~4のアルコキシカルボニル基、アミノ基、炭素数1~3のアルキルアミノ基、または炭素数1~3のアシルアミノ基を示す。

R<sup>3</sup>は炭素数1~5のアルキル基、炭素数2~5のアルケニル基、炭素数1~5のアルコキシ基または



(式中R<sup>4</sup>は、水素原子、炭素数1~5のアルキル基、炭素数2~5のアルケニル基、炭素数1~5のアルコキシ基、トリフルオロメチル基、シアノ基、炭素数1~3のアルキルチオ基、炭素数1~3のアルキルスルフィニル基、炭素数1~3のアルキルスルホニル基、ニトロ基、またはハロゲン原子を表わす)を示す]で表わされるN-ベンジルアミド類およびこれを有効成分とする殺虫、殺ダニ剤に存する。

以下、本発明を詳細に説明する。

上記一般式(I)において、Aはイオウ原子、酸

R<sup>3</sup>はメチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、t-ブチル基等の炭素数1~5の直鎖もしくは分岐鎖アルキル基；アリル基、メタリル基、2-ブテニル基等の炭素数2~5の直鎖もしくは分岐鎖アルケニル基；メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、イソプロポキシ基、n-ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、t-ブトキシ基等の炭素数1~5の直鎖もしくは分岐鎖アルコキシ基；または



(式中R<sup>4</sup>は、水素原子；メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、t-ブチル基等の炭素数1~5の直鎖もしくは分岐鎖アルキル基；アリル基、メタリル基、2-ブテニル基等の炭素数2~5の直鎖もしくは分岐鎖アルケニル基；メトキシ基、エトキシ基、n-プロポキシ基、イソプロポキシ基、n-ブトキシ基、イソブトキシ基、sec-ブトキシ基、t-ブトキシ基等の炭素数1~5の直鎖もしくは分岐鎖アルコキシ基；トリフルオロメチル基；シアノ基；

メチルチオ基、エチルチオ基、*n*-プロピルチオ基、イソプロピルチオ基等の炭素数1~3の直鎖もしくは分岐鎖アルキルチオ基；メチルスルフィニル基、エチルスルフィニル基、*n*-プロピルスルフィニル基、イソプロピルスルフィニル基等の炭素数1~3の直鎖もしくは分岐鎖アルキルスルフィニル基；メチルスルホニル基、エチルスルホニル基、*n*-プロピルスルホニル基、イソプロピルスルホニル基等の炭素数1~3の直鎖もしくは分岐鎖アルキルスルホニル基；ニトロ基；または塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子を表わす)を示し、好ましくは、炭素数1~5のアルキル基または

$-O-\text{C}_6\text{H}_4-\text{R}^4$  (式中 $\text{R}^4$ は、アルキル基；トリフルロメチル基；シアノ基；炭素数1~3のアルキルチオ基を表す)を示す。

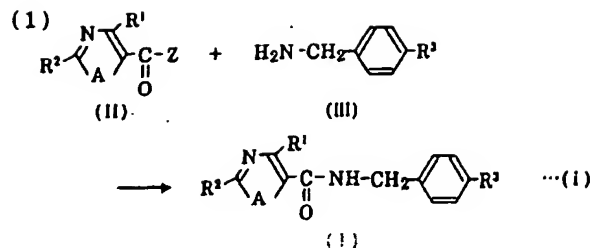
次に、本発明化合物の製法について説明する。

上記一般式(I)で表わされる本発明化合物は、下記反応式(i)(ii)又は(iii)に従って製造することができる。

ロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホラン、アセトニトリル等の極性溶媒中、好ましくは-20~60°C、更に好ましくは0~20°Cの温度範囲で、塩基の存在下に反応させることにより、一般式(I)で表わされる化合物を得ることができる。使用される塩基としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム等の無機塩基およびピリジン、トリエチルアミン等の有機塩基が挙げられる。

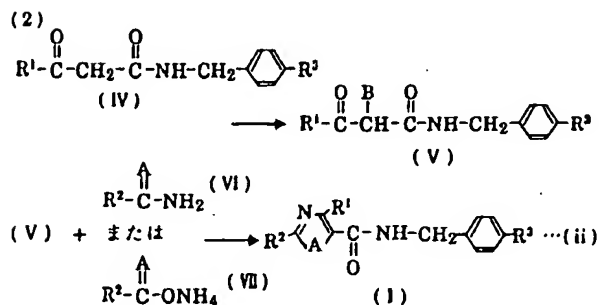
また、上記一般式(II)において、Zがヒドロキシル基、メトキシ基、エトキシ基またはプロポキシ基を示す場合には、一般式(II)で表わされる化合物と一般式(III)で表わされる化合物を、無溶媒またはN,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピロリドン、ジメチルスルホキシド、スルホラン等の高沸点溶媒中、好ましくは150~250°C、更に好ましくは200~250°Cの温度範囲で反応させることにより、一般式(I)で表わされる化合物を得ることができる。

なお、上記一般式(II)及び(III)で表わされる化合物は公知の方法で容易に得られる。



(上記反応式中、 $\text{R}^1$ 、 $\text{R}^2$ 、 $\text{R}^3$ およびAは前記一般式(I)で定義したとおりであり、Zは塩素原子、臭素原子、ヒドロキシル基、メトキシ基、エトキシ基またはプロポキシ基を示す。)

上記一般式(II)において、Zが塩素原子または臭素原子を示す場合には、一般式(II)で表わされる化合物と一般式(III)で表わされる化合物を、水；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素、ジクロロエタン等のハロゲン化炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；アセトン、メチルエチルケトン等のケトン類；酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル類またはN,N-ジメチルホルムアミド、N-メチルピ



(上記反応式中、A、および $\text{R}^2$ は前記一般式(I)で定義した通りである。 $\text{R}^1$ は前記一般式(I)で定義したうち、メチル基またはエチル基を、 $\text{R}^3$ は前記一般式(I)で定義したうち、アルキル基、フェニル基、アルコキシカルボニル基、アミノ基、アルキルアミノ基またはアシルアミノ基を示す。

Bは塩素原子、臭素原子などのハロゲン原子またはアセチル基を示す。)

上記一般式(V)において、Bがハロゲン原子を示す場合には、一般式(V)で表わされる化合物と塩化スルフリル、塩素、臭素、N-クロロスクシンイミド、N-ブロモスクシンイミド等のハロゲン化剤をベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、

ジオキサン等のエーテル類等の溶媒中、好ましくは $-10\sim 30^{\circ}\text{C}$ の温度範囲で反応させることにより、一般式(V)で表わされる化合物を得ることができる。

上記一般式(V)において、Bがアセチル基を示す場合には、一般式(IV)で表わされる化合物と、酢酸鉛を、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類等の溶媒中、好ましくは $-10\sim 30^{\circ}\text{C}$ の温度範囲で反応させることにより、一般式(V)で表わされる化合物を得ることができる。

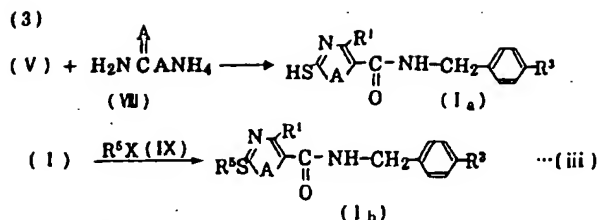
更に一般式(V)で表わされる化合物と、一般式(VI)または(VII)で表わされる化合物をベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル類；ギ酸、酢酸等極性溶媒中で、好ましくは $0\sim 100^{\circ}\text{C}$ で反応させることにより一般式(I)で表わされる化合物を得ることができる。

なお、一般式(IV)で表わされる化合物は公知の方法で容易に得られる。

フラン、ジオキサン等のエーテル溶媒中、好ましくは $-10\sim 30^{\circ}\text{C}$ の温度範囲で反応させることにより、一般式(I<sub>b</sub>)で表わされる化合物が得られる。

なお、一般式(VII)で表わされる化合物は公知の方法で容易に得られる。

かくして得られる本発明化合物を、殺虫、殺ダニ剤として使用する場合には、単独で用いてもよいが、通常は一般の農薬と同様に補助剤を用いて水和剤、粉剤、乳剤等の形態に製造し、そのまま、あるいは希釈して使用する。補助剤としては、一般の農薬の製剤に通常使用されるものが用いられる。例えば、カオリン、ベントナイト、タルク、珪藻土、ホワイトカーボン、デンプン等の固体担体；水アルコール類(メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、エチレングリコール等)、ケトン類(アセトン、メチルエチルケトン、シクロヘキサノン等)、エーテル類(ジエチルエーテル、ジオキサン、セロソルブ類等)、脂肪族炭化水素類(ケロシン、灯油等)、芳香族炭化水素類(ベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、メチルナフタレン等)、ハロゲン化炭化水



(上記反応式中、R<sup>1</sup>、およびR<sup>3</sup>は前記一般式(I)で定義した通りである。

Aは前記一般式(I)で定義したうちイオウ原子を、R<sup>5</sup>は炭素数1~5のアルキル基を、Xは塩素、臭素等ハロゲン原子を示す。)

前記(2)で得られた一般式(V)で表わされる化合物と、一般式(VII)で表わされる化合物を、メタノール、エタノール等のアルコール類；ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン等のエーテル溶媒中、好ましくは $0\sim 100^{\circ}\text{C}$ の温度範囲で反応させることにより、一般式(I<sub>a</sub>)で表わされる化合物が得られる。

更にこの化合物を、一般式(IX)で表わされる化合物と、ベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類；ジエチルエーテル、テトラヒドロ

素(ジクロロエタン、トリクロロベンゼン、四塩化炭素等)、酸アミド類(ジメチルホルムアミド等)、エステル類(酢酸エチル、酢酸ブチル、脂肪酸グリセリンエステル類等)、ニトリル類(アセトニトリル等)等の溶媒；非イオン系界面活性剤(ポリオキシエチレンアルキルアリルエーテル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート等)、カチオン系界面活性剤(アルキルジメチルベンジルアンモニウムクロリド、アルキルピリジニウムクロリド等)、アニオン系界面活性剤(アルキルベンゼンスルホン酸塩、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸塩等)、両性系界面活性剤(アルキルジメチルベタイン、ドデシルアミノエチルグリシン等)等の界面活性剤等が挙げられる。これらの固体担体、溶媒、界面活性剤は、それぞれ必要に応じて1種または2種以上の混合物として使用される。製剤中の本発明化合物の含有量は、特に限定されるものではないが、通常、水和剤では好ましくは1~90重量%、更に好ましくは10~80重量%、粉剤では好ましくは0.5~20重量%、更に好ましくは1~10重量%、乳剤では好ましくは1~90重量%、更に

好ましくは10～50重量%の有効成分を含有する製剤として使用される。

本発明化合物を殺虫、殺ダニ剤として使用する場合、通常、活性成分が好ましくは1～1000ppm、更に好ましくは5～500ppmの濃度範囲で使用する。

また、本発明化合物は、所望によっては他の殺虫剤、殺ダニ剤、農園芸用殺菌剤、植物成長調節剤等と混用または併用することも可能である。

#### [作用]

一般式(I)で表わされる本発明化合物は、例えば下記に示す半翅目、鱗翅目、鞘翅目、直翅目、双翅目等の昆虫およびダニに対し、著しい防除活性を有するが、勿論これらのみに限定されるものではない。

- 1 半翅目; セジロウンカ、トビイロウンカ、ヒメトビイロウンカ等のウンカ類  
ツマグロヨコバイ、オオヨコバイ等のヨコバイ類  
モモアカアブラムシ等のアブラムシ類

酸クロリド0.48gを滴下した。

滴下終了後、室温で1時間攪拌を続けた後注水した。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:酢酸エチル/ヘキサン=2/1)にて精製し、表-1記載の化合物(No.1)0.60gを得た。

本化合物のNMRスペクトルは、以下の通りである。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ): 1.32 (9H, s), 2.73 (3H, s), 4.58 (2H, s), 6.06 (1H, m), 7.30 (2H, d), 7.44 (2H, d), 8.74 (1H, s)

同様にして、表-1記載の化合物 No.2, 6, 19, 20, 22, 26, 27 を合成した。

#### 実施例 2

N-(4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル)-4-メチル-5-オキサゾールカルボキサミドの製造

N-(4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル)-アセト酢酸アミド11.7gをジエチルエーテル

- 2 鱗翅目; コナガ、ハスモンヨトウ、ニカメイチュウ、コブノメイガ等  
3 鞘翅目; アズキゾウムシ等  
4 双翅目; イエバエ、ネッタイシマカ、アカイエカ等  
5 ダニ目; ナミハダニ、ニセナミハダニ、ミカンハダニ等のハダニ類  
オウシマダニ、カズキダニ等のマダニ類  
ミナミツメダニ等のツメダニ類

#### [実施例]

次に本発明化合物の製造例、製剤例および試験例によって、本発明を更に具体的に説明するが、本発明はその要旨を越えない限り、以下の例に限定されるものではない。

#### 実施例 1

N-(4-t-ブチルベンジル)-4-メチル-5-チアゾールカルボキサミドの製造

t-ブチルベンジルアミン0.50gおよびトリエチルアミン0.7gをトルエン10mlに溶かし、氷浴にて冷却し、攪拌下に4-メチル-5-チアゾールカルボン

120mlに溶かし、氷浴にて冷却し、攪拌下に塩化スルフルリル7.09gを滴下し、室温で12時間攪拌を続けた後注水した。有機層を水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を減圧下に留去し、N-(4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル)-2-クロロアセト酢酸アミド12.0gを得た。この内、1.16gとギ酸アンモニウム2.0gをギ酸7mlに溶かし、10時間加熱還流した。ギ酸を減圧留去し、炭酸カリウム水溶液で中和した後、酢酸エチルで抽出し、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:酢酸エチル/ヘキサン=1/1)で精製し、表-1記載の化合物(No.24)0.23gを得た。

本化合物のNMRスペクトルは、以下の通りである。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ): 2.56 (3H, s), 4.64 (2H, d), 6.62 (1H, m), 6.97-7.74 (9H, m), 7.80 (1H, m)

同様に、表-1記載の化合物 No.3~5, 7~16, 21, 23, 34 を製造した。

### 実施例 3

N-(4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル)-2,4-ジメチル-5-オキサゾールカルボキサミドの製造

N-(4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル)-アセト酢酸アミド1.05gをベンゼン5mlに溶かし、四酢酸鉛1.33gを加え、1.5時間攪拌した。反応系に酢酸エチルを加え不溶物を濾別し、水、続いて飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。得られた残留物を酢酸6mlに溶かし、酢酸アンモニウム1.0gを加え、40分間加熱還流した。酢酸を減圧留去し、酢酸エチルで抽出し、重曹水、水、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。得られた残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:酢酸エチル/ヘキサン=2/3)で精製し、表-1記載の化合物(No.25) 0.54gを得た。

本化合物のNMRスペクトルは、以下の通りである。

$^1\text{H-NMR}$  ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ): 2.46 (3H, s), 2.50 (3H, s), 4.63 (2H, d) 6.53 (1H, s), 7.00 - 7.75 (8H, m)

### 実施例 4

N-(4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル)-2-メルカプト-4-メチル-5-チアゾールカルボキサミドおよびN-(4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル)-2-メチルチオ-4-メチル-5-チアゾールカルボキサミドの製法

N-(4-(4-トリフルオロメチルフェノキシ)ベンジル)-2-クロロ酢酸アミド1.54gをエタノール10mlに溶かしたものに、アンモニウムジチオカーバメート0.48gを加えて、2時間加熱還流した。これを水に注いだ後、エーテルにて抽出し、水洗し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:酢酸エチル/ヘキサン=1/2)で精製し、表-1記載の化合物(No.17) 0.54gを得た。更に、この化合物0.42gをTHF 3mlに溶かし、攪拌下にヨウ化メチル0.5mlを滴下し、一晚攪拌した。溶媒を減圧留去

した後、残留物を酢酸エチルに溶かし、飽和食塩水で洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥後、濃縮した。残留物をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒:酢酸エチル/ヘキサン=1/3)で精製し、表-1記載の化合物(No.18) 0.23gを得た。

これらの化合物のNMRスペクトルは、以下の通りである。

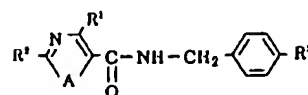
### 化合物 No.17

$^1\text{H-NMR}$  ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ): 2.51 (3H, s), 4.50 (2H, d), 6.90 - 7.76 (9H, m)

### 化合物 No.18

$^1\text{H-NMR}$  ( $\delta$ ,  $\text{CDCl}_3$ ): 2.51 (3H, s), 2.53 (3H, s), 4.53 (2H, d), 6.07 (1H, s), 7.00 - 7.74 (8H, m)

表-1



No	A	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物性
1	S	Me	H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	mp 68 - 69 °C
2	S	Me	H	-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CF <sub>3</sub>	mp 92 - 96 °C
3	S	Me	Me	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	mp 64 - 67 °C
4	S	Me	Me	-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CF <sub>3</sub>	mp 105 - 109 °C
5	S	Me	Me	-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -SMe	mp 101 - 103 °C
6	S	H	Me	-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CF <sub>3</sub>	mp 159 - 160 °C
7	S	Me	Et	-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CF <sub>3</sub>	mp 100 - 103 °C
8	S	Me	Et	-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -Me	n <sub>D</sub> <sup>25.0</sup> 1.5989
9	S	Me	Et	-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CN	mp 119 - 120 °C
10	S	Me	Ph	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	無定形固体
11	S	Me	Ph	-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CF <sub>3</sub>	mp 141 - 142 °C
12	S	Me	COOEt	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	無定形固体
13	S	Me	COOEt	-O-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> -CF <sub>3</sub>	無定形固体

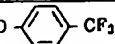
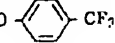
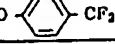
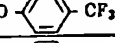
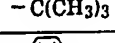





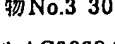
No	A	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	物性
14	S	Me	NHMe	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	mp 195-196 °C
15	S	Me	NHMe	-O-  -CF <sub>3</sub>	mp 181-182 °C
16	S	Me	NH <sub>2</sub>	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	mp 115-117 °C
17	S	Me	SH	-O-  -CF <sub>3</sub>	無定形固体
18	S	Me	SMe	-O-  -CF <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>25.0</sup> 1.5920
19	S	Me	Cl	-O-  -CF <sub>3</sub>	mp 118-190 °C
20	S	Me	OMe	-O-  -CF <sub>3</sub>	無定形固体
21	S	Et	Et	-O-  -CF <sub>3</sub>	n <sub>D</sub> <sup>25.0</sup> 1.5614
22	S	CF <sub>3</sub>	Me	-O-  -CF <sub>3</sub>	mp 100-101 °C
23	O	Me	H	-C(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	mp 112-114 °C
24	O	Me	H	-O-  -CF <sub>3</sub>	無定形固体
25	O	Me	Me	-O-  -CF <sub>3</sub>	mp 121-122 °C
26	O	Me	Et	-O-  -CF <sub>3</sub>	mp 84-86 °C
27	O	Me	OMe	-O-  -CF <sub>3</sub>	mp 104-105 °C

表-1中、Meはメチル基、Etはエチル基、Phはフェニル基を表わす。

邦化学社、商標名)15部を加えて、有効成分20%を含有する乳剤を得た。

#### 製剤例4 フロアブル剤

表-1の本発明化合物No.3 30部、エチレングリコール8部、ソルポールAC3032(東邦化学社、商標名)5部、キサンタンガム0.1部を水56.9部によく混合分散させた。次にこのスラリー状混合物を、ダイノミル(シンマルエンタープライゼス社)で湿式粉碎して、有効成分30%を含有するフロアブル剤を得た。

次に本発明化合物の試験例を示す。なお、以下に示す表2-5の化合物No.は前記表-1の化合物No.に対応する。

#### 試験例1 コナガの幼虫に対する効果

製剤例1の処方に従って製剤された本発明化合物を、展着剤ソルポール3005 X(東邦化学社、商標名)200 ppを含む水で希釈し、有効成分濃度が500 ppmになるように調製した。この薬液中に、キャベツ切葉(5 cm × 5 cm)を1分間浸漬した。薬液を風乾した後、プラスチックカップ(径7 cm)に入れ、これにコナガの3令幼虫を5頭放虫し、25 ± 1 °Cの恒温室内に放置し

次に本発明化合物の製剤例を示す。なお、以下に「部」、「%」とあるのは、それぞれ、「重量部」、「重量%」を意味する。

#### 製剤例1 水和剤

表-1の本発明化合物No.3 20部、カーブックス#80(塩野義製薬社、商標名)20部、クニライト201(クニミネ工業社、商標名)55部、高級アルコール硫酸エステル系界面活性剤ソルポール8070(東邦化学社、商標名)5部を配合し、均一に混合粉碎して、有効成分20%を含有する水和剤を得た。

#### 製剤例2 粉剤

表-1の本発明化合物No.3 2部、クレー(日本タルク社)92.8部、ホワイトカーボン5部、イソプロピルアシッドホスフェート0.2部を配合し、均一に混合粉碎して、有効成分2%を含有する粉剤を得た。

#### 製剤例3 乳剤

表-1の本発明化合物No.3 20部を、カワカゾール(川崎化成社、商標名)32.5部およびメチルホルムアミド32.5部からなる混合溶媒に溶解させ、これにポリオキシエチレン系界面活性剤ソルポール3005 X(東

邦化学社、商標名)15部を加えて、有効成分20%を含有する乳剤を得た。(2反復)。

処理4日後に幼虫の生死を調査し、下式により殺虫率を算出した。結果を表-2に示す。

$$\text{殺虫率(\%)} = \frac{\text{死虫数}}{\text{死虫数} + \text{生虫数}} \times 100$$

表-2

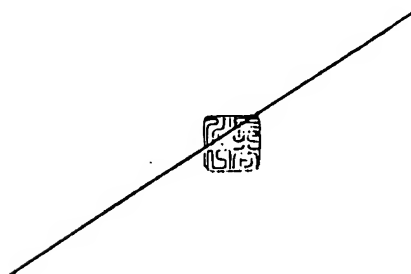
化合物 No	殺虫率(%)
2	100
4	100
5	100
7	100
8	100
15	100
17	100
18	100
19	100
20	100
24	100
25	100
26	100
無処理	0

# 試験例2 トビイロウンカの幼虫に対する効果

製剤例1の処方に従って製剤された本発明化合物を、展着剤ソルポール3005 X(東邦化学社、商標名) 200 ppmを含む水で希釈し、有効成分濃度が500 ppmになるように調製した。直径2.5 cm、高さ18 cmのガラス円筒にトビイロウンカの幼虫5頭と稲苗を入れ、メッシュを貼ったキャップをかぶせ、上部から上記薬液0.5 mlを散布し、25 ± 1°Cの恒温室内に放置した。(2反復)。

処理5日後に円筒内の幼虫の生死を調査し、下式により殺虫率を算出した。結果を表-3に示す。

$$\text{殺虫率}(\%) = \frac{\text{死虫数}}{\text{死虫数} + \text{生虫数}} \times 100$$



放置した。(2反復)

処理5日後に円筒内の成虫の生死を調査し、下式により殺虫率を算出した。結果を表-4に示す。

$$\text{殺虫率}(\%) = \frac{\text{死虫数}}{\text{死虫数} + \text{生虫数}} \times 100$$

表-4

化合物 No	殺虫率(%)
4	100
5	100
7	100
8	90
9	90
20	80
25	100
26	100
27	100
無処理	0

# 試験例4 ナミハダニの幼虫と卵に対する効果

製剤例1の処方に従って製剤された本発明化合物を、展着剤ソルポール3005 X(東邦化学社、商標名) 200 ppmを含む水で希釈し有効成分濃度が500 ppmになるように調製した。インゲンの初生葉にナミハダ

表-3

化合物 No	殺虫率(%)
2	100
3	100
4	100
5	100
7	100
8	100
9	100
18	100
20	100
24	100
25	100
26	100
27	100
無処理	0

# 試験例3 アズキゾウムシの成虫に対する効果

製剤例1の処方に従って製剤された本発明化合物を、展着剤ソルポール3005 X(東邦化学社、商標名) 200 ppmを含む水で希釈し、有効成分濃度が500 ppmになるように調製した。直径2.5 cm、高さ18 cmのガラス円筒にアズキゾウムシの成虫5頭とアズキ豆2個を入れ、メッシュを貼ったキャップをかぶせ、上部から上記薬液0.5 mlを散布し、25 ± 1°Cの恒温室内に

ニ雌成虫を10頭接種して、24時間室内に放置し、産卵させた。このナミハダニ雌成虫および卵を保持した葉を、上記薬液中に5秒間浸漬した後、25 ± 1°Cの恒温室内に放置した(2反復)。

処理5日後に成虫の生死を調査し、下式により殺虫率を算出した。

$$\text{殺虫率}(\%) = \frac{\text{死虫数}}{\text{死虫数} + \text{生虫数}} \times 100$$

また同時に、卵の孵化状態と孵化幼虫の生死を調査した。卵に対する効果は、○(生存虫率0%)、×(生存虫率20%以上)の3段階のグレードで判断した。結果を表-5に示す。

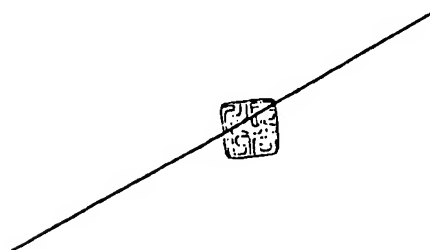




表-5

化合物 No	殺虫率 (%)	殺虫率 (%)
2	100	○
3	100	×
5	100	○
7	100	○
9	100	×
10	100	×
18	100	×
19	90	×
20	100	○
23	100	○
24	100	○
25	100	○
26	100	○
27	100	○
無処理	0	×

## [本発明の効果]

以上の試験例からも明らかなように、本発明化合物は、殺虫および殺ダニ剤として有用である。

出願人 三菱化成株式会社

代理人 弁理士 長谷川 一

(ほか1名)

第1頁の続き

⑤Int. Cl.<sup>5</sup>

識別記号

庁内整理番号

C 07 D 263/34  
263/38  
263/46  
263/48

7624-4C  
7624-4C  
7624-4C  
7624-4C